

# 水稻用除草剤ベンゾピシクロンの除草効果と作用機 作の解明

著者	関野 景介
内容記述	筑波大学博士（農学）学位論文・平成23年3月25日 授与（甲第5745号）
発行年	2011
URL	<a href="http://hdl.handle.net/2241/114676">http://hdl.handle.net/2241/114676</a>

氏 名 (本籍)	せきの けい すけ 関 野 景 介 (茨 城 県)
学 位 の 種 類	博 士 (農 学)
学 位 記 番 号	博 甲 第 5745 号
学位授与年月日	平成 23 年 3 月 25 日
学位授与の要件	学位規則第 4 条第 1 項該当
審 査 研 究 科	生命環境科学研究科
学 位 論 文 題 目	水稻用除草剤ベンゾビシクロンの除草効果と作用機作の解明

主	査	筑波大学教授	農学博士	松 本 宏
副	査	筑波大学教授	博士 (理学)	田 中 俊 之
副	査	筑波大学教授	農学博士	小 林 勝一郎
副	査	筑波大学講師	博士 (農学)	春 原 由香里

## 論 文 の 内 容 の 要 旨

わが国の農業の中心をなす稲作において雑草の発生は大きな問題であるが、イネー雑草間に選択性を持った水稻用除草剤は、生産性の向上のみならず、労働力の低減化にも大きな貢献をしている。一方で、同じ作用機序を有する除草剤の連年使用に伴い、スルホニルウレア系除草剤 (SU 剤) 抵抗性雑草や匍匐性多年生イネ科雑草の出現といった要防除対象雑草の変遷という新たな問題も発生している、本研究では、これらの新しい雑草問題にいち早く対応した画期的な除草剤の創製およびその殺草特性と作用機作を解明することを目的として行われたものである。

ベンゾビシクロン ([3-(2-クロロ-4-メシルベンゾイル)-2-フェニルチオビシクロ [3.2.1] オクト-2-エン-4-オン]) は、(株) エス・ディー・エス バイオテックが創製・開発した白化型水稻用除草剤であり、2001 年に農薬登録を取得・上市し、現在も混合剤の開発が進行中である。本剤の探索研究においては、畑用途の除草活性が知られていたベンゾイルシクロヘキサジオン系化合物を初期リードとして、ジケトン部分、ベンゾイル部分の種々の変換、最適化、さらには、トリケトン構造の化学修飾による物理化学性の改変を進め、イネー雑草間の選択性の増大、水溶解度や土壌移行性の改善を通じた地下水汚染、水田外流亡の防止といった環境負荷の低減化を実現させた。構造的には、これまでに類を見ないビシクロオクタン環構造と化学的徐放化特性に寄与する分子内カルボニル基のフェニルチオエノールエーテルへのプロドラッグ化構造を特徴としており、水稻用に適用転換した初のシクロヘキサジオン系化合物として創製された。

本剤の作用機作研究においては、ベンゾビシクロンの代謝物である加水分解体がプラストキノン生合成経路上の 4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ (4-HPPD) を阻害することを、大腸菌を用いて構築したニンジン由来の本酵素の過剰発現系を用いて明らかとした。プラストキノンはカロテノイド生合成中間体のフィトエンの不飽和化の際に放出される水素の受容体として働いており、HPPD の阻害は間接的にカロテノイド生合成経路上のフィトエンデサチュラーゼを阻害することでフィトエンの蓄積と光合成色素の減少、それに続く白化を引き起こす過程が明らかとなった。

さらに、ベンゾビシクロンの水稻用除草剤としての適用性研究においては、水田への施用量が 200 ～ 300

g/ha という低薬量において、移植栽培、直播栽培にも使用できるイネへの高い安全性を有し、一方では、主要雑草であるヒエ類、イヌホタルイ、コナギ、アゼナ類を始めとする一年生広葉雑草、ミズガヤツリへも卓効性を示すという幅広い殺草スペクトラムを有することを明らかとした。特に、カヤツリグサ科の重要防除雑草であるイヌホタルイには、発生前～5葉期といった広い処理適期幅と、除草効果の持続期間が8週間程度といった長期残効性を持つという特性を明らかとした。また、SU剤抵抗性雑草の対策剤としての有用性、匍匐性多年生イネ科雑草のアシカキ、エゾノサヤヌカグサへの卓効性を有することも示した。さらに、ベンゾビシクロンは超長鎖脂肪酸生合成阻害剤、プロトックス阻害剤、光合成系Ⅱ阻害剤と混合した際に相乗作用性を示すことも見出した。これらの特長を活用して種々の混合剤が開発され、2010年度には61剤を上市し、50万haを超える水田で使用され、農業生産場面に貢献することができた。

## 審 査 の 結 果 の 要 旨

本論文は、除草剤ベンゾビシクロンの除草効果の特徴とその作用機作を詳細に解析したものである。化合物の選抜の部分では、必要とされる水田用除草剤としての特性と環境安全性を重要視しながら、膨大な生物試験を通してベンゾビシクロン発見に到達した過程が記述されている。また、作用機作研究の部分では、フィトエンデサチュラーゼ活性を新規の方法で測定できるようにしたこと、ニンジンのHPPD遺伝子が大腸菌に組み込んでHPPD酵素の大量発現系を構築し新規の発色法により活性測定を可能にしたこと、さらには、ベンゾビシクロンの加水分解体がこの酵素の阻害に働く活性本体であることを明らかにしている点が高く評価される。さらに、実際の使用場面におけるベンゾビシクロンの殺草スペクトラムを解析し、近年問題となっているスルホニルウレア抵抗性雑草や多年生イネ科雑草の防除に有効であることや、混合した際に共力効果を示すいくつかの既存剤があることを示している。これらの結果は水田雑草防除へのベンゾビシクロンの利用および新規の混合剤の開発に直結する極めて有効な知見となっている。

よって、著者は博士（農学）の学位を受けるに十分な資格を有するものと認める。